ビクタルビ配合錠

第 2 部 CTD の概要

2.3 品質に関する概括資料

ギリアド・サイエンシズ株式会社

2.3.S　　原薬*

1. JAN

（日本名）
ビクテグラビルナトリウム（JAN）
エムトリシタビン（JAN）
テノホビル　アラフェナミドフマル酸塩（JAN）

（英名）
Bictegravir sodium（JAN）
Emtricitabine（JAN）
Tenofovir alafenamide fumarate（JAN）

2. 化学名

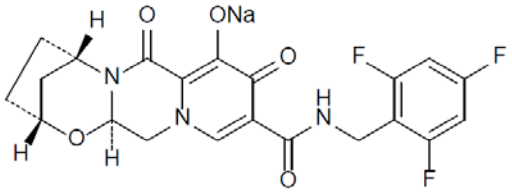
ビクテグラビルナトリウム
Monosodium (2*R*,5*S*,13a*R*)-7,9-dioxo-10-{[(2,4,6-trifluorophenyl)methyl]carbamoyl}-2,3,4,5,7,9,13,13a-octahydro-2,5-methanopyrido[1',2':4,5]pyrazino[2,1-*b*][1,3]oxazepin-8-olate

エムトリシタビン
4-Amino-5-fluoro-1-[(2*R*,5*S*)-2-(hydroxymethyl)-1,3-oxathiolan-5-yl]pyrimidin-2(1*H*)-one

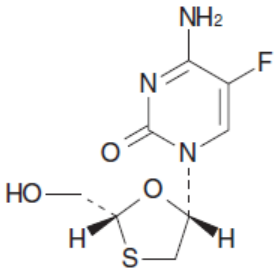
テノホビル　アラフェナミドフマル酸塩
1-Methylethyl-*N*-[(*S*)-{[(1*R*)-2-(6-amino-9*H*-purin-9-yl)-1-methylethoxy]methyl}phenoxyphosphinoyl]-L-alaninate hemifumarate

3. 構造式

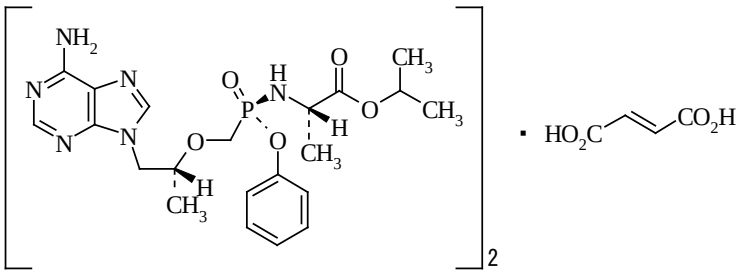
ビクテグラビルナトリウム



エムトリシタビン



テノホビル アラフェナミドフマル酸塩



4. 分子式及び分子量

ビクテグラビルナトリウム
分子式：$C_{21}H_{17}F_3N_3NaO_5$
分子量：471.36

エムトリシタビン
分子式：$C_8H_{10}FN_3O_3S$
分子量：247.25

テノホビル　アラフェナミドフマル酸塩
分子式：$(C_{21}H_{29}N_6O_5P)_2 \cdot C_4H_4O_4$
分子量：1069.00

5. 性状

ビクテグラビルナトリウム
微黄白色～黄色の固体

エムトリシタビン
白色～帯黄白色の粉末

テノホビル　アラフェナミドフマル酸塩
白色～灰白色又は白色～くすんだ黄赤色の粉末

6. 融点

ビクテグラビルナトリウム
融点：約 330°C（分解）

エムトリシタビン
融点：約 155°C

テノホビル　アラフェナミドフマル酸塩
融点：約 132°C

7. 溶解性

ビクテグラビルナトリウム

酢酸に溶けやすく、*N*-メチルピロリジノンにやや溶けにくく、ジメチルスルホキシド溶けにくく、水（pH 8.8）又はメタノールに極めて溶けにくく、水（pH 1.8-7.8）、エタノール又はジクロロメタンにほとんど溶けない。

エムトリシタビン

水、メタノールに溶けやすく、アセトニトリルに溶けにくく、酢酸イソプロピルに極めて溶けにくい。

テノホビル　アラフェナミドフマル酸塩

メタノールに溶けやすく、エタノール（99.5）にやや溶けやすく、水又は 2-プロパノールにやや溶けにくく、アセトニトリル又はアセトンに溶けにくく、トルエンに極めて溶けにくい。

*「2.3.S 原薬」を新薬承認情報提供時に置き換え

2.3.P　　製剤*

1. 組成

1 錠中ビクテグラビルナトリウム 52.5mg（ビクテグラビルとして 50mg)、エムトリシタビン 200mg、テノホビル　アラフェナミドフマル酸塩 28mg（テノホビル　アラフェナミドとして 25mg 含有

2. 添加物

結晶セルロース、クロスカルメロースナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、黒酸化鉄、三二酸化鉄、マクロゴール 4000、ポリビニルアルコール（部分けん化物)、タルク、酸化チタン

3. 性状

紫褐色のフィルムコーティング錠

4. 安定性

試 験		保存条件	保存期間	保存形態	結　　果
長期保存試験		25°C/60%RH 30°C/75%RH	24ヵ月※	100 mL の白色高密度ポリエチレン製容器（シリカゲル3 g 入り）／閉栓	規格値の範囲内の変動であった
加速試験		40°C/75%RH	6ヵ月		
苛酷試験	温度	－20°C	1週間		
		50°C/なりゆき湿度	1週間		
	光	総照度120万 lx･hr 以上 及び 総近紫外放射エネルギー 200 W･hr/m²以上照射		ペトリ皿（無包装／アルミニウム包装）	変化なし

試験項目：性状（外観)、類縁物質、水分、微生物限度（長期保存試験、加速試験)、溶出性、含量
※：継続中

*「2.3.P 製剤」を新薬承認情報提供時に置き換え